#### (12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

#### (19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle

Bureau international





(43) Date de la publication internationale 7 octobre 2004 (07.10.2004)

PCT

# (10) Numéro de publication internationale WO 2004/084856 A3

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup>: A61K 9/16

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2004/000729

(22) Date de dépôt international : 24 mars 2004 (24.03.2004)

(25) Langue de dépôt :

français

(26) Langue de publication :

français

(30) Données relatives à la priorité : 03/03568 24 mars 2003 (24.03.2003) FR

- (71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : ORALANCE PHARMA [FR/FR]; Incubateur Paris Biotech, 24 rue du Faubourg Saint Jacques, F-75014 Paris (FR).
- (72) Inventeurs; et
- (75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement): IOUALALEN, Karim [FR/FR]; 8, avenue du Coustou, F-31650 Saint Orens de Gameville (FR). RAYNAL, Rose, Anne [FR/FR]; 8 avenue du Coustou, F-31650 Saint Orens de Gameville (FR).
- (74) Mandataires: BREESE, Pierre etc.; Breesé-Majerowicz, 3 avenue de l'Opéra, F-75001 Paris (FR).
- (81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible): AE, AG, AL, AM, AT,

AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Publiée:

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues
- (88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 25 novembre 2004

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

- (54) Title: NOVEL GALENICAL SYSTEM FOR ACTIVE TRANSPORT, METHOD FOR PREPARATION AND USE
- (54) Titre : NOUVEAU SYSTEME GALENIQUE POUR LE TRANSPORT D'ACTIF, PROCEDE DE PREPARATION ET UTILISATION
- (57) Abstract: The invention relates to a novel galenical system for taste masking, protecting an active substance, in particular in an active medium, modulating releasing properties, masking mucous irritability and toxicity of certain active substances, for preparing aqueous forms which have a masked taste, are stable and pH independent. Said invention also relates, in particular to a galenical system which is embodied in the form of lipidic solid particles and strictly hydrophobic and devoid of water, surface active agents, of fatty non-neutralised acid.
  - (57) Abrégé: L'invention propose un nouveau système galénique permettant le masquage du goût, la protection du principe actif, particulièrement en milieu acide, la possibilité de modulation des propriétés de libération, le masquage des effets d'irritabilité mucosale et de la toxicité de certains principes actifs, la préparation de formes aqueuses, à goût masqué, stables et pH indépendantes. Particulièrement, l'invention a pour objet un système galénique, sous forme de particules lipidiques solides, strictement hydrophobes ne contenant strictement pas d'eau, ni de tensioactifs, ni d'agents émulsionnants, ni de traces de solvants, caractérisé en ce qu'il comprend au moins une cire hydrophobe et au moins un acide gras non neutralisé.



ıational Application No . ∪ı TFR2004/000729

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A61K9/16 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC **B. FIELDS SEARCHED** Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 A61K Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT Category 9 Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages Relevant to claim No. WO 94/12157 A (KV PHARMACEUTICAL COMPANY) Α 1-7,99 June 1994 (1994-06-09) claims 1-3,6-8 page 9, line 1 - line 6 page 14, line 4 - line 19 page 17; example 1 page 19; example 4 WO 99/65448 A (IOULALEN, KARIM; ET AL.) X 15-17 23 December 1999 (1999-12-23) cited in the application claims 1-5,13-16 page 9; example 6 -/--Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex. Special categories of cited documents: \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventile step when the document is combined with one or more other such document, such combination being obvious to a person skilled in the art. O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "&" document member of the same patent family Date of the actual completion of the international search Date of mailing of the international search report 7 October 2004 18/10/2004 Name and mailing address of the ISA Authorized officer European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo ni, Fax: (+31-70) 340-3016 Boulois, D

I----ational Application No

C.(Continu	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	[/FR2004/000729
Category °		Relevant to claim No.
A	EP 1 197 207 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 17 April 2002 (2002-04-17) claims 1,13-16 page 5, line 43 - page 6, line 9 page 6; examples 1-4	1-4,6-9
X	US 4 132 753 A (MITCHELL S. BLICHARE) 2 January 1979 (1979-01-02) claims 1,2	1-4,6,7, 9
A	EP 0 911 038 A (SALSARULO, ODETTE; ET AL.) 28 April 1999 (1999-04-28) claims 1-3 examples 1-3	1-4,6,7,
x	WO 00/76481 A (CIP NINETY TWO 92 S A; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 December 2000 (2000-12-21) page 7 - page 10; examples	1-14, 18-20
x	GB 1 323 161 A (WYETH JOHN & BROTHER LTD) 11 July 1973 (1973-07-11)	1-6, 8-14,
	page 2 - page 3; examples	18-20
X	WO 00/76478 A (CIP NINETY TWO 92 S A; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 December 2000 (2000-12-21) page 15; example 8	1-10, 12-14, 18-20
< _	WO 99/13864 A (SHIRE LAB INC) 25 March 1999 (1999-03-25) page 2, paragraph 3 page 9, paragraph 1 page 41 - page 42; example 8	1-14, 18-20
		1

Information on patent family members

| FR2004/000729

cited	atent document d in search report	ŀ	Publication date		Patent family member(s)		Publication date
MO	9412157	A	09-06-1994	AU CA DE DE EP ES JP KR WO US	5681294 2150119 69332801 69332801 0670716 2194863 2949448 8505841 168715 9412157 5494681	A1 D1 T2 A1 T3 B2 T B1 A1	22-06-1994 09-06-1994 30-04-2003 29-01-2004 13-09-1995 01-12-2003 13-09-1999 25-06-1996 15-01-1999 09-06-1994
WO	9965448	A	23-12-1999	FR AU CA EP WO US	2779962 4151099 2341580 1030687 9965448 6572892	A1 A A1 A2 A2	27-02-1996 
EP	1197207	A	17-04-2002	AU CA EP JP	7827301 2358361 1197207 2002161033	A1 A2	11-04-2002 10-04-2002 17-04-2002 04-06-2002
US	4132753	Α	02-01-1979	NONE	ر جب الناء حب عن الله على يجبر جبان ثلبا لاب .		
EP	0911038	A	28-04-1999	FR AT DE DE EP ES GR HK JP PT US	2769839 194498 69800210 69800210 0911038 2150305 3034549 1020527 3459349 11189538 911038 6221853	T D1 T2 A1 T3 T3 A1 B2 A	23-04-1999 15-07-2000 17-08-2000 15-03-2001 28-04-1999 16-11-2000 31-01-2001 25-05-2001 20-10-2003 13-07-1999 29-12-2000 24-04-2001
WO	0076481	A	21-12-2000	IT AU CA CN DE DE DE DE DE DE TR DE TR US	MI991316 235234 5077200 2377299 1355694 60001835 60001835 1198226 0076481 1198226 1287822 2194732 2003501458 20016107 1198226 200200561 6773720	T A A1 T D1 T2 T3 A1 A2 T3 T A T	14-12-2000 15-04-2003 02-01-2001 21-12-2000 26-06-2002 30-04-2003 13-11-2003 21-07-2003 21-12-2000 24-04-2002 05-03-2003 01-12-2003 14-01-2003 11-02-2002 31-07-2003 21-06-2002 10-08-2004
	 1323161	Α	 11-07-1973	NONE			

Information on patent family members

national Application No

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
WO 0076478	A	21-12-2000	IT IT AU CA CN DE DK WO EP ES JP NO PT TR	MI991317 A1 MI20000422 A1 251449 T 5680100 A 2377301 A1 1355693 T 60005819 D1 60005819 T2 1183014 T3 0076478 A1 1183014 A1 2208349 T3 2003501457 T 20016108 A 1183014 T 200200562 T2	14-12-2000 03-09-2001 15-10-2003 02-01-2001 21-12-2000 26-06-2002 13-11-2003 06-05-2004 09-02-2004 21-12-2000 06-03-2002 16-06-2004 14-01-2003 24-01-2002 31-12-2003 21-05-2002
WO 9913864	A	25-03-1999	AU CA EP JP WO US	9496798 A 2302275 A1 1028712 A2 2002522354 T 9913864 A2 2001006650 A1	05-04-1999 25-03-1999 23-08-2000 23-07-2002 25-03-1999 05-07-2001

Pregande Internationale No rc [/FR2004/000729

				DEMAN	

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

# B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement) CIB 7 A61K

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés) EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. DOCUM	ENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS	<del></del>
Catégorie °	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	WO 94/12157 A (KV PHARMACEUTICAL COMPANY) 9 juin 1994 (1994-06-09) revendications 1-3,6-8 page 9, ligne 1 - ligne 6 page 14, ligne 4 - ligne 19 page 17; exemple 1 page 19; exemple 4	1-7,9
X	WO 99/65448 A (IOULALEN, KARIM; ET AL.) 23 décembre 1999 (1999-12-23) cité dans la demande revendications 1-5,13-16 page 9; exemple 6  -/	15–17

Voir la suite du cadra C pour la grant de la cadra C	
X Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents	X Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe
° Catégories spéciales de documents cités:	
<ul> <li>"A" document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent</li> <li>"E" document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date</li> <li>"L" document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)</li> <li>"O" document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens</li> <li>"P" document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée</li> </ul>	<ul> <li>*T* document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'apparienenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention</li> <li>*X* document particulièrement pertinent; l'inven tion revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément document particulièrement pertinent; l'inven tion revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métler</li> <li>*&amp;* document qui fait partie de la même famille de brevets</li> </ul>
Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée	Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale
7 octobre 2004	18/10/2004
Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationa Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL. – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl,	le Fonctionnaire autorisé
Fax: (+31-70) 340-3016	Boulois, D
Formulaire PCT/ISA/210 (deuxième feuille) (Janvier 2004)	

rui/FR2004/000729

C.(suita)		2004/000729
	OCCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS  didentification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	
	pertinents	no. des revendications visée
A	EP 1 197 207 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 17 avril 2002 (2002-04-17) revendications 1,13-16 page 5, ligne 43 - page 6, ligne 9 page 6; exemples 1-4	1-4,6-9
X	US 4 132 753 A (MITCHELL S. BLICHARE) 2 janvier 1979 (1979-01-02) revendications 1,2	1-4,6,7, 9
A	EP 0 911 038 A (SALSARULO, ODETTE; ET AL.) 28 avril 1999 (1999-04-28) revendications 1-3 exemples 1-3	1-4,6,7,
X	WO 00/76481 A (CIP NINETY TWO 92 S A ; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 décembre 2000 (2000-12-21) page 7 - page 10; exemples	1-14, 18-20
<b>X</b>	GB 1 323 161 A (WYETH JOHN & BROTHER LTD) 11 juillet 1973 (1973-07-11)	1-6, 8-14,
	page 2 - page 3; exemples	18–20
X	WO 00/76478 A (CIP NINETY TWO 92 S A ; AJANI MAURO (PA); VILLA ROBERTO (PA); FOSSATI) 21 décembre 2000 (2000-12-21) page 15; exemple 8	1-10, 12-14, 18-20
x	WO 99/13864 A (SHIRE LAB INC) 25 mars 1999 (1999-03-25) page 2, alinéa 3 page 9, alinéa 1 page 41 - page 42; exemple 8	1-14, 18-20
:		
:		

Renseignements rela

iux membres de familles de brevets

Drande Internationale No FuT/FR2004/000729

Doc	cument brevet cité	$\neg \tau$	Date de			7FK2004/000/29
au ra	pport de recherche		publication		Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO	9412157	A	09~06-1994	AU CA DE EP ES JP KR WO US	5681294 A 2150119 A1 69332801 D1 69332801 T2 0670716 A1 2194863 T3 2949448 B2 8505841 T 168715 B1 9412157 A1 5494681 A	30-04-2003 29-01-2004 13-09-1995 01-12-2003 13-09-1999 25-06-1996 15-01-1999
WO	9965448	A	23-12-1999	FR AU CA EP WO US	2779962 A1 4151099 A 2341580 A1 1030687 A2 9965448 A2 6572892 B1	24-12-1999 05-01-2000 23-12-1999 30-08-2000
EP	1197207	A	17-04-2002	AU CA EP JP	7827301 A 2358361 A1 1197207 A2 2002161033 A	11-04-2002 10-04-2002 17-04-2002 04-06-2002
US	4132753	Α	02-01-1979	AUCI	JN	
EP	0911038	A	28-04-1999	FR AT DE DE EP ES GR HK JP JP PT US	2769839 A1 194498 T 69800210 D1 69800210 T2 0911038 A1 2150305 T3 3034549 T3 1020527 A1 3459349 B2 11189538 A 911038 T 6221853 B1	23-04-1999 15-07-2000 17-08-2000 15-03-2001 28-04-1999 16-11-2000 31-01-2001 25-05-2001 20-10-2003 13-07-1999 29-12-2000 24-04-2001
WO	0076481	A	21-12-2000	IT AT CA CN DE DE DK WO EP EP NO PT TR US	MI991316 A1 235234 T 5077200 A 2377299 A1 1355694 T 60001835 D1 60001835 T2 1198226 T3 0076481 A1 1198226 A1 1287822 A2 2194732 T3 2003501458 T 20016107 A 1198226 T 200200561 T2 6773720 B1	14-12-2000 15-04-2003 02-01-2001 21-12-2000 26-06-2002 30-04-2003 13-11-2003 21-07-2003 21-12-2000 24-04-2002 05-03-2003 01-12-2003 14-01-2003 11-02-2002 31-07-2003 21-06-2002 10-08-2004
	1323161					

Renseignements rela

ux membres de familles de brevets

ande internationale No

ruT/FR2004/000729 Document brevet cité Date de Membre(s) de la Date de au rapport de recherche publication famille de brevet(s) publication WO 0076478 Α 21-12-2000 IT MI991317 A1 14-12-2000 IT MI20000422 A1 03-09-2001 AT 251449 T 15-10-2003 ΑU 5680100 A 02-01-2001 CA 2377301 A1 21-12-2000 CN 1355693 T 26-06-2002 60005819 D1 DE 13-11-2003 DE 60005819 T2 06-05-2004 DK 1183014 T3 09-02-2004 WO 0076478 A1 21-12-2000 ΕP 1183014 A1 06-03-2002 ES 2208349 T3 16-06-2004 JP 2003501457 T 14-01-2003 NO 20016108 A 24-01-2002 PT 1183014 T 31~12-2003 TR 200200562 T2 21-05-2002 WO 9913864 Α 25-03-1999 AU 9496798 A 05-04-1999 CA 2302275 A1 25~03-1999 ΕP 1028712 A2 23-08-2000 JP 2002522354 T 23-07-2002 WO 9913864 A2 25-03-1999 US 2001006650 A1 05-07-2001